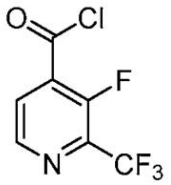
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年2月7日(2022.2.7)

【国際公開番号】WO2019/152374
【公表番号】特表2021-512163(P2021-512163A)
【公表日】令和3年5月13日(2021.5.13)
【出願番号】特願2020-562089(P2020-562089)
【国際特許分類】
C07D401/06(2006.01)
C07D213/78(2006.01)
C07D487/04(2006.01)
A61K 31/519(2006.01)
A61P 29/00(2006.01)
A61P 35/00(2006.01)
A61P 37/02(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
【FI】
C07D401/06 CSP
C07D213/78
C07D487/04 140
A61K 31/519
A61P 29/00
A61P 35/00
A61P 37/02
A61P 43/00 111

【手続補正書】
【提出日】令和4年1月28日(2022.1.28)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式ＩＩＩの化合物：
【化１】



III

またはその塩を、４－ヒドロキシピペリジンと反応させて、式ＩＶの化合物：

【化２】



IV

またはその塩を形成することを含む、プロセス。

【請求項２】

前記４－ヒドロキシピペリジンとの反応が、塩基の存在下において遂行される、請求項１に記載のプロセス。

【請求項３】

前記塩基が第三級アミンである、請求項２に記載のプロセス。

【請求項４】

前記第三級アミンがＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンである、請求項３に記載のプロセス。

【請求項５】

前記４－ヒドロキシピペリジンとの反応が、ジクロロメタンを含む溶媒構成要素中で遂行される、請求項１～４のいずれか１項に記載のプロセス。

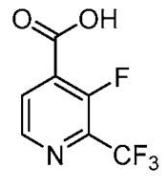
【請求項６】

前記４－ヒドロキシピペリジンとの反応が約２５℃～約３５℃の温度で遂行される、請求項１～５のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項７】

前記式ＩＩＩの化合物が、式ＩＩの化合物：

【化３】



II

またはその塩を、塩化オキサリルと反応させて、前記式ＩＩＩの化合物またはその塩を形成することを含むプロセスによって形成される、請求項１～６のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項８】

前記塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応が、触媒量のジメチルホルムアミド（ＤＭＦ）の存在下において遂行される、請求項７に記載のプロセス。

【請求項９】

前記塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応が、ジクロロメタンを含む溶媒構成要素中で遂行される、請求項７または８のプロセス。

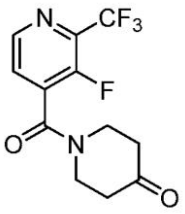
【請求項１０】

前記塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応が、約１５℃～約２５℃の温度で遂行される、請求項７～９のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項１１】

前記式ＩＶの化合物またはその塩を酸化条件下で反応させて、式Ｖの化合物：

【化４】



V

またはその塩を形成することをさらに含む、請求項１～１０のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項１２】

前記酸化条件が第１の酸化剤を含む、請求項１１に記載のプロセス。

【請求項１３】

前記酸化条件が第２の酸化剤を含む、請求項１２に記載のプロセス。

【請求項１４】

前記第１の酸化剤がトリクロロイソシアヌル酸（ＴＣＩＣ）である、請求項１２または１３に記載のプロセス。

【請求項１５】

前記ＴＣＩＣが、前記式ＩＶの化合物に関して、約０．５～約０．７モル当量の間で存在する、請求項１４に記載のプロセス。

【請求項１６】

前記第２の酸化剤が２，２，６，６－テトラメチル－１－ピペリジニルオキシ（ＴＥＭＰＯ）である、請求項１３～１５のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項１７】

前記ＴＥＭＰＯが、前記式ＩＶの化合物に関して、約０．０１５～約０．０２５モル当量の間で存在する、請求項１６に記載のプロセス。

【請求項１８】

前記酸化条件下での前記式ＩＶの化合物の反応が、重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム及び臭化ナトリウムのうちの１つまたは複数をさらに含む、請求項１１～１７のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項１９】

前記酸化条件下での前記式ＩＶの化合物の反応が、ジクロロメタンを含む溶媒構成要素をさらに含む、請求項１１～１８のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項２０】

前記溶媒構成要素が水をさらに含む、請求項１９に記載のプロセス。

【請求項２１】

前記酸化条件が、トリクロロイソシアヌル酸を、前記式ＩＶの化合物及びＴＥＭＰＯを含む溶液へ約０℃～約５℃の温度で添加することを含む、請求項１１に記載のプロセス。

【請求項２２】

前記トリクロロイソシアヌル酸の添加が、少なくとも２つの小分けでトリクロロイソシアヌル酸を添加することを含む、請求項２１に記載のプロセス。

【請求項２３】

前記溶液が、前記添加後に約０℃～約５℃の温度で約３０分間撹拌される、請求項２１または２２に記載のプロセス。

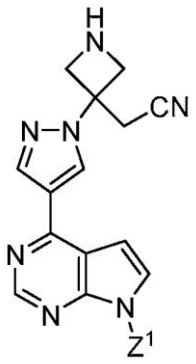
【請求項２４】

前記撹拌後に、前記溶液を約２０℃～約２５℃の温度へ約１時間～約２時間の時間で暖めることをさらに含む、請求項２３に記載のプロセス。

【請求項２５】

還元剤の存在下において、前記式Ｖの化合物を、式ＶＩの化合物：

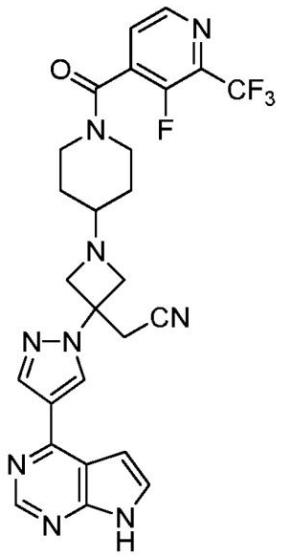
【化５】



VI

またはその塩と反応させて、式Ｉの化合物：

【化６】



I

またはその塩を形成することをさらに含み、
式中、Ｚ１はＨまたは保護基である、
請求項１１～２４のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項２６】

Ｚ１がＨである、請求項２５に記載のプロセス。

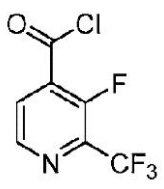
【請求項２７】

前記還元剤が、水素化シアノホウ素ナトリウムまたは水素化トリアセトキシホウ素ナトリウムである、請求項２５または２６に記載のプロセス。

【請求項２８】

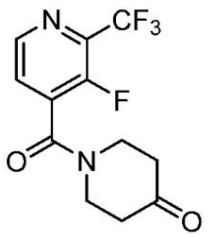
式ＩＩＩの化合物：

【化７】



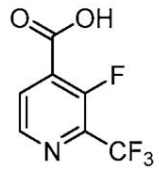
III

またはその塩を、４－ピペリドンまたはその塩と反応させて、式Ｖの化合物：
【化８】



Ｖ

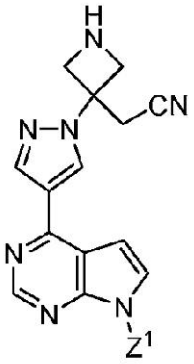
またはその塩を形成することを含む、プロセス。
【請求項２９】
前記４－ピペリドンまたはその塩が、４－ピペリドン塩酸塩である、請求項２８に記載のプロセス。
【請求項３０】
前記４－ピペリドンまたはその塩が、４－ピペリドン塩酸塩一水和物である、請求項２８に記載のプロセス。
【請求項３１】
前記反応が塩基をさらに含む、請求項２８～３０のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項３２】
前記塩基が炭酸ナトリウムである、請求項３１に記載のプロセス。
【請求項３３】
前記４－ピペリドンとの前記式ＩＩＩの化合物の前記反応が、ジクロロメタンを含む溶媒構成要素中で遂行される、請求項２８～３２のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項３４】
前記４－ピペリドンとの前記式ＩＩＩの化合物の前記反応が、約０℃～約５℃の温度で遂行される、請求項２８～３３のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項３５】
前記式ＩＩＩの化合物が、式ＩＩの化合物：
【化９】



ＩＩ

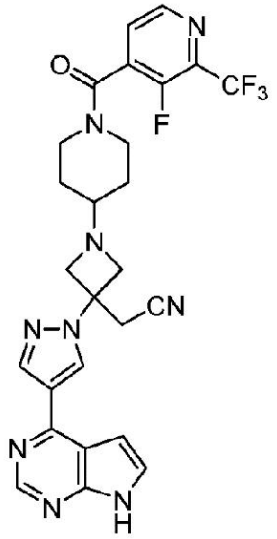
またはその塩を、塩化オキサリルと反応させて、前記式ＩＩＩの化合物またはその塩を形成することを含むプロセスによって形成される、請求項２８～３４のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項３６】
前記塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応が、触媒量のジメチルホルムアミド（ＤＭＦ）の存在下において遂行される、請求項３５に記載のプロセス。
【請求項３７】
前記塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応が、ジクロロメタンを含む溶媒構成要素中で遂行される、請求項３５または３６のプロセス。
【請求項３８】
塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応が、約１５℃～約２５℃の温度で遂行される、請求項３５～３７のいずれか１項に記載のプロセス。

【請求項３９】
前記式ＩＩＩの化合物が、前記式ＩＩＩの化合物を４－ピペリドンと反応させる前に単離されない、請求項３５～３８のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項４０】
塩化オキサリルとの前記式ＩＩの化合物の反応及び４－ピペリドンとの前記式ＩＩＩの化合物の反応が、単一反応器中で遂行される、請求項３５～３９のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項４１】
還元剤の存在下において、前記式Ｖの化合物を、式ＶＩの化合物：
【化１０】



VI

またはその塩と反応させて、式Ｉの化合物：
【化１１】



I

またはその塩を形成することをさらに含み、
式中、Ｚ１はＨまたは保護基である、
請求項２８～４０のいずれか１項に記載のプロセス。
【請求項４２】
Ｚ１がＨである、請求項４１に記載のプロセス。
【請求項４３】
前記還元剤が、水素化シアノホウ素ナトリウムまたは水素化トリアセトキシホウ素ナトリウムである、請求項４１または４２に記載のプロセス。